

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005年3月31日 (31.03.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/028441 A1(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 213/69, 309/38,  
311/56, 413/10, 407/10, 215/22, A61K 31/366, 31/37,  
31/4412, 31/4439, 31/4704, 31/5377, 7/06, A61P 43/00,  
17/14, 1/16, 11/00, 13/12, 17/02, 9/10, 9/12(TAKAHASHI, Junya) [JP/JP]; 〒6660262 兵庫県川辺  
郡猪名川町伏見台 4-3-8 4 Hyogo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/013989

(74) 代理人: 榎本 雅之, 外(ENOMOTO, Masayuki et al.);  
〒5418550 大阪府大阪市中央区北浜四丁目 5 番 3 3 号  
住友化学知的所有権センター株式会社内 Osaka (JP).

(22) 国際出願日: 2004年9月16日 (16.09.2004)

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が  
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,  
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,  
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,  
LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI,  
NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG,  
SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,  
VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

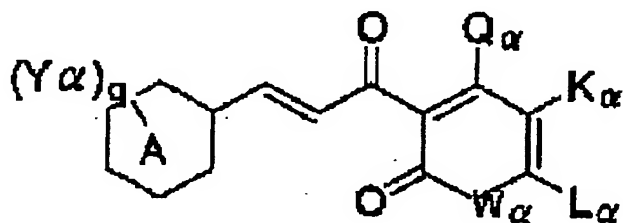
(30) 優先権データ:  
特願2003-324157 2003年9月17日 (17.09.2003) JP  
特願2003-324156 2003年9月17日 (17.09.2003) JP  
特願2003-324155 2003年9月17日 (17.09.2003) JP  
特願2003-324150 2003年9月17日 (17.09.2003) JP(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可  
能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD,  
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY,  
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,  
CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,  
IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF,  
BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN,  
TD, TG).(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 住友化  
学株式会社 (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY,  
LIMITED) [JP/JP]; 〒1048260 東京都中央区新川二丁  
目 27 番 1 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 冨ヶ原 祥隆  
(TOMIGAHARA, Yoshitaka) [JP/JP]; 〒5600013 大阪  
府豊中市上野東 3-5-7 1 Osaka (JP). 東 清史 (HI-  
GASHI, Kiyoshi) [JP/JP]; 〒5420012 大阪府大阪市  
中央区谷町 6-2-3 3-7 0 6 Osaka (JP). 高橋 淳也添付公開書類:  
— 国際調査報告書2 文字コード及び他の略語については、定期発行される  
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語  
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: CINNAMOYL DERIVATIVES AND USE THEREOF

(54) 発明の名称: シンナモイル誘導体およびその用途



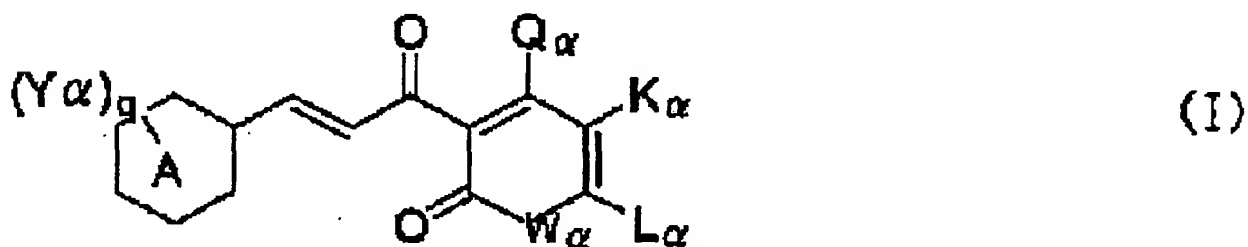
(I)

(57) Abstract: Cinnamoyl derivatives represented by the general formula (I) which have inhibitory effects on type I collagen gene transcription: (I) wherein A is a benzene ring or a pyridine ring;  $Y_{\alpha}$  is a group on carbon which is selected from group  $X_{\alpha}$  or group  $Y_{\alpha}$  with the proviso that two adjacent  $Y_{\alpha}$ 's may form a group selected from group  $Z_{\alpha}$  and fused with the ring A; q is an integer of 0 to 5; group  $X_{\alpha}$  includes OH and so on; group  $Y_{\alpha}$  includes 3- to 12-membered carbo- and hetero-cycles which may be substituted with OH or the like; group  $Z_{\alpha}$  includes 5- to 12-membered carbo- and hetero-cycles fused with the ring A which cycles may be substituted with thio or the like;  $Q_{\alpha}$  is optionally substituted hydroxy or amino;  $W_{\alpha}$  is O or -NT $_{\alpha}$ - (wherein T $_{\alpha}$  is H or a substituent); and  $K_{\alpha}$  and  $L_{\alpha}$  are each H or a substituent, or  $K_{\alpha}$  and  $L_{\alpha}$  may form optionally substituted, C<sub>1-10</sub> alkylene or alkenylene, with the proviso that the compound wherein A is a benzene ring,  $W_{\alpha}$  is O,  $K_{\alpha}$  and  $L_{\alpha}$  form 1,3-butadienylene,  $Q_{\alpha}$  is OH, q is 1, and  $Y_{\alpha}$  is OEt is excluded.

[続葉有]

(57) 要約:

本発明は、式 (I)



〔式中、A：ベンゼン環又はピリジン環；Y<sub>α</sub>：C上の基であってX<sub>α</sub>群又はY<sub>α</sub>群の基。隣接した2個のY<sub>α</sub>は、Z<sub>α</sub>群の基をなしてA環と縮環してもよい。；q：0～5の整数；X<sub>α</sub>群：OH等；Y<sub>α</sub>群：OH等で置換されてもよい3～10員環の炭素環又は複素環等；Z<sub>α</sub>群：チオ基等で置換されてもよい5～12員環の炭素環又は複素環であってA環と縮環する基；Q<sub>α</sub>：置換されてもよい水酸基又はアミノ基；W<sub>α</sub>：O又は-N T<sub>α</sub>-（T<sub>α</sub>は、H又は置換基）；K<sub>α</sub>、L<sub>α</sub>：H又は置換基を表す。K<sub>α</sub>とL<sub>α</sub>とは、置換基を有してもよいC1～10アルキレン基又はアルケニレン基をなすことがある。；但し、A：ベンゼン環、W<sub>α</sub>：O、K<sub>α</sub>及びL<sub>α</sub>：1，3-ブタジエニレン、Q<sub>α</sub>：OHの時、qが1でY<sub>α</sub>がOEtの化合物等を除く。〕で表されるI型コラーゲン遺伝子転写抑制作用を示すシンナモイル化合物等に関する。